

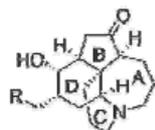
21L-am10S

ドミノエンインメタセシス反応を鍵とした lyconesidine 類の合成研究

○黒瀬 朋浩¹, 塚野 千尋¹, 竹本 佳司¹ (¹京大院薬)

【目的】Lyconesidine A (**1**) および B (**2**) はヒカゲノカズラ科のヒメスギランより単離・構造決定されたホーセチミン型リコポジウムアルカロイドである。本天然物は、複雑に縮環した四環性骨格上に第四級炭素を含む連続した 6 つの不斉中心を有する。また、生物活性としてマウスリンパ腫 L1210 細胞に対する細胞毒性とチューブリンの重合阻害作用が報告されている。これまでに全合成の報告はない。我々は最近 CD 環部の新規骨格構築法を開発しており、本法を利用して興味深い縮環構造と生物活性をあわせ持つ lyconesidine 類の全合成を目指すこととした。

【方法・結果】ジエンイン化合物 **5** からドミノエンインメタセシス反応により AB 環部を一挙に構築し、四環性化合物 **6** へと導くことを計画した。まず、前述の新規 CD 環部構築法を用い、ジアゾケトン **3** から核間位に第四級炭素を持つデカヒドロキノリン **4** を合成した。その後、8 工程の変化でドミノエンインメタセシス反応前駆体 **5** を得た。種々の検討の後、化合物 **5** から望みの四環性化合物 **6** を得る条件を見出した。本発表ではドミノエンインメタセシス反応と、その後の天然物合成を目指した誘導化の詳細を報告する。



R = H: lyconesidine A (**1**)
R = OH: lyconesidine B (**2**)

